11 Veröffentlichungsnummer:

0 071 792 A2

12

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(1) Anmeldenummer: 82106335.1

2 Anmeldetag: 15.07.82

(C07D487/04, 239/00, 231/00), (C07D487/04, 249/00,

239/00)

3 Priorität: 01.08.81 DE 3130633

Anmelder: BASF Aktlengesellschaft,
 Carl-Bosch-Strasse 38, D-6700 Ludwigshafen (DE)

Weröffentlichungstag der Anmeldung: 16.02.83 Patentblatt 83/7

> ② Erfinder: Elcken, Karl, Dr., Waldstrasse 63, D-6706 Wachenhelm (DE) Erfinder: Schelb, Klaus, Dr., Duerkhelmer Strasse 7, D-6701 Schauernhelm (DE) Erfinder: Theobald, Hans, Dr., Parkstrasse 2, D-6703 Limburgerhof (DE) Erfinder: Pommer, Ernst-Heinrich, Dr., Berliner Platz 7, D-6703 Limburgerhof (DE) Erfinder: Ammermann, Eberhard, Dr., Sachsenstrasse 3, D-6700 Ludwigshafen (DE)

Benannte Vertragsstaaten: AT BE CH DE FR GB IT LI LU
NL SE

- 7-Amino-azolo(1,5-a)pyrimidine und diese enthaltende Fungizide.
- 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine der Formei

worln

R¹ gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, weiche gegebenenfalls substituiert sind,

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl oder Aryl,

n 1 oder 2,

A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet, wobel

R⁴ dle Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl und zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet und diese enthaltende Fungizide. 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine und diese enthaltende Fungizide

Die vorliegende Erfindung betrifft neue 7-Amino-azolo-5 [1,5-a]pyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und diese enthaltende Fungizide.

Es ist bekannt, daß 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine z.B. das 7-Amino-2-methyl-5-phenyl-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin pharmakologische Eigenschaften besitzen (FR-PS 2 448 542; DD-PS 99 794; DD-PS 55 956; J. pharm. Soc. Japan 84 (1964), S. 1113-1118). Es ist ferner bekannt, N-Trichlormethylthio-phthalimid als Fungizid zu verwenden (Chemical Week 1972, June 21, Seite 63).

Es wurde nun gefunden, daß neue 7-Amino-azolo[1,5-a]pyri-midine der Formel

$$R^{1}$$
 $N^{H_{2}}$ N^{N} N^{N}

worin

10

15

20

gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl,
Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi,
Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol,
Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls
im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen
oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2, R² und R³ Wasserstoff, Alkyl oder Aryl,

- A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeuten, wobei
- die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano, oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu zwei Doppelbindungen bedeutet,

eine gute fungizide Wirkung, insbesondere gegen Phycomyceten haben.

- Unter den Resten R¹ sind beispielsweise gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxi substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₁₂-Alkoxi, Cyano, C₃-C₈-Cycloalkyl, Aryl (Phenyl), Aryloxi (Phenyloxi), Arylthio (Phenylthio), Arylalkyl (Benzyl), Arylalkyloxi
- (Benzyloxi), Arylalkylthio (Benzylthio) mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylteilen, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxi, Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiert sein können, zu verstehen.

Unter den Resten R², R³ und R⁴ in der Bedeutung von R² ist beispielsweise Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder gegebenenfalls durch Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxi substituiertes

25 Phenyl zu verstehen. Darüber hinaus kann R⁴ Chlor, Brom, Cyan oder C₁-C₄-Alkoxicarbonyl bedeuten oder zusammen mit R³ eine gegebenenfalls bis zu zwei Doppelbindungen enthaltende C₃-C₄-Alkylenkette bedeuten. Unter Alkyl oder Alkyl einer Alkoxigruppe bei den Resten R¹, R², R³ und R⁴ ist

30 je nach Zahl der angegebenen Kohlenstoffatome Methyl, Ethyl, Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, Nonyl, Decyl, Undecyl oder Dodecyl und ihre Isomeren zu verstehen.

Es wurde ferner gefunden, daß man 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidine der Formel I erhält, indem man substituierte

10

15

20

25

- 3 -

Benzylcyanide der Formel

in welcher R^1 und R^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit 5(3)-Aminopyrazolen der Formel

oder mit

5(3)-Amino-1,2,4-triazolen der Formel

in welcher R^3 und R^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt.

Die Umsetzung kann in Gegenwart oder Abwesenheit von
Lösungsmitteln durchgeführt werden. Vorteilhaft ist es,
solche Lösungsmittel zu verwenden, gegenüber denen die
Einsatzstoffe weitgehend inert sind und in denen sie ganz
oder teilweise löslich sind. Als Lösungsmittel kommen insbesondere Alkohole wie Ethanol, Propanole, Butanole, Glykole oder Glykolmonoether, Diethylenglykole oder deren
Monoether, Amide wie Dimethylformamid, Diethylformamid,
Dibutylformamid, N,N-Dimethylacetamid, niedere Alkansäuren
wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure und Mischungen
dieser Lösungsmittel mit Wasser in Frage. Die Umsetzungs-

0. Z. 0050/35319

temperaturen liegen zwischen 50 und 300°C, vorzugsweise bei 50 bis 150°C, wenn in Lösung gearbeitet wird.

Die neuen 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine werden gegebenenfalls nach Verdampfen des Lösungsmittels oder Verdünnen mit Wasser als kristalline, meist sehr reine Verbindungen isoliert. Bei Verwendung von niederen Alkansäuren als Lösungsmitteln ist es zweckmäßig, gegebenenfalls nach teilweisem Verdampfen der Alkansäure, die Reste der Alkansäure durch Zugabe von wäßrigem Alkali zu neutralisieren, wobei die neuen 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine meist in sehr reiner Form auskristallisieren.

Die für die Herstellung der 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine benötigten substiuierten Benzylcyanide der Formel

20

5

10

15

sind teilweise bekannt oder können nach bekannten Methoden aus Benzylcyaniden und Carbonsäureestern mit Alkalialko-holaten oder Alkalihydriden hergestellt werden (J. Amer. Chem. Soc. 73, (1951) S. 3766).

25

Allgemeine Herstellungsvorschrift für die substituierten Benzylcyanide der Formel II

1,5 Mol Natriumalkoholat wird in 1 1 Toluol eingetragen
und anschließend 1,0 Mol eines Benzylcyanids und dann
2,0 Mol eines Carbonsäureesters unter Rühren zugetropft,
wobei die Temperatur auf 40 bis 50°C ansteigt. Nach 2-stündigem Nachrühren bei 75 bis 80°C wird abgekühlt und mit
2 1 Wasser versetzt. Aus der wäßrigen Phase isoliert man
nach zweimaligem Waschen mit 0,2 1 Toluol durch Ansäuern

O.Z. 0050/35319

mit halbkonzentrierter (etwa 50 Gew.%) Schwefelsäure auf pH 2 das substituierte Benzylcyanid der Formel II (Ausbeuten: 70 bis 90 %).

5 Auf diese Weise können folgende substituierten Benzylcyanide der Formel

II,

10

hergestellt werden:

15

20

25

O. Z. 0050/35319

	- R ¹ .	R ²	Fp. (°C)
	2-CH ₃	Н	89
	3-CH ₃	H	119
	4-C(CH ₂) ₂	H	169
5	4-с(čн ₃) ₃ 3-сн ₃ о	H	102
	3-01	H	178
	4-01	H	164
	4-Br	H	176
	3-CF ₃	H	107
10	3-CF ₃	CH ₃	82
	3-C ₆ H ₅ O 4-C ₂ H ₅ 4-C ₆ H ₁₃ O	Н	45
	4-C ₂ H ₅	. H	90
	4-C ₆ H ₁₃ O	H	116
0.0	4-1C ₃ H ₇	H	84
15	(3) (4)	н	205
-	3,4-Cl ₂	H	170
	2-CH ₃ , 4-C(CH ₃) ₃	H	120
20	4-C6H5	H	228
	4-C6H5CH2-O	H	188
	4 (ČIĆH ₂ ČH(CH ₃)CH ₂)	H	81
	2,4-C1	H	166
	4-CN	H	222
25	R ¹ = &-Naphthyl	Н	
	$R^{1} = \alpha - \text{Naphthyl}$	H	

O. Z. 0050/35319

Die folgenden Beispiele betreffen die Herstellung der neuen Wirkstoffe.

Beispiel 1

5

10

15

21,3 g m-Trifluormethyl-2-formyl-benzylcyanid und 9,7 g 3(5)-Amino-5(3)-methylpyrazol wurden in 100 ml Eisessig 4 Stunden am Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde der Ansatz mit 500 ml Wasser verdünnt und mit 2 n NaOH-Lösung auf pH 5 bis 6 eingestellt, wobei ein öliges Produkt ausfiel, das nach Anreiben kristallisierte. Nach Absaugen der Kristalle, mehrfachen Waschen mit Wasser und Trocknen im Vakuum bei 50°C erhielt man 25,0 g 7-Amino-2-methyl-6-(3'-trifluormethylphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin vom Fp. 176°C (Verbindung 10).

$$C_{14}H_{11}N_{4}F_{3}$$
 (M 292)

C H N

20 ber.: 57,54 3,79 19,17

gef.: 57,6 3,9 18,9

Beispiel 2

25 10,5 g p-tert.-Butyl-2-formyl-benzylcyanid und 4,8 g 3(5)-Amino-5(3)-methylpyrazol wurden in 40 ml Dimethylformamid 3 Stunden am Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wurden 150 ml Wasser zugetropft. Nach dem Absaugen der Kristalle, Waschen mit Wasser und Trocknen im Vakuum bei 50°C erhielt man 11,3 g 7-Amino-2-methyl-6-(4'-tert.butyl-phenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin vom Fp. 218°C (Verbindung 5).

O.Z. 0050/35319

$$C_{17}^{H}_{20}^{N}_{4}$$
 (M 280)

C H N
ber.: 72,83 7,19 19,98
gef.: 72,8 7,1 19,9

Beispiel 3

5

11,8 g m-Phenoxi-2-formylbenzylcyanid und 4,3 g 3-Aminotriazol wurden in 40 ml Eisessig 6 Stunden am Rückfluß
erhitzt, nach dem Abkühlen mit 300 ml Wasser versetzt und
mit 2 n NaOH auf pH 6 eingestellt. Die ausgefallenen
Kristalle wurden abgesaugt und getrocknet (14,1 g). Nach
Lösen in 30 ml heißem Dimethylformamid abkühlen, Fällen
mit 10 ml Methanol, Waschen der abgesaugten Kristalle
mit weiterem Methanol und Trocknen erhielt man 9,6 g
7-Amino-6-(3'-phenoxiphenyl)-1,2,4-triazolo[1,5-a]pyrimidin
vom Fp. 248-250°C (Verbindung 44).

 $c_{17}^{H_{13}N_50}$ (M 303)

C H N ber: 67,32 4,32 23,09 gef: 67,8 4,2 22,9

Nach den oben beschriebenen Verfahren wurden folgende 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine hergestellt.

30

0. z. 0050/35319

•	R ¹ -	R ²	NH ₂ N-N-R ³				
Nr.	R ¹	R ²	R ³	.1			
1	3-CF ₃	CH2	CH ₃]			
2	3,4(CH ₃ 0) ₂	CH ₃	сн ₃	1			
_				_			

Fp. $(^{\circ}C)$ Α CR4 H 212 cr4 188 H CR4 CH₃ 2-CH₃ 10 H H 224 CR4 CH3 H H 158 CH3 CR⁴
CR⁴
CR⁴ H H 218 CH3 3-CH₃0 6 H 124 H CH3 3-C1 174 H Н 7 CH3 168 Н 8 4-C1 H 15 CR4 CH3 9 4-Br H Н 171 3-CF₃ CR4 CH₃ Н 176 H 10 CH₃ CR4 173 Н H 11 CR⁴ CH₃ Н H 150 12 CH₃ 132 Н H 20 13 CR4 328 14 H. H CH₃ cr4 162 H H CH₃ 3,4-č1₂ H Н 160 CR4 25 CH₂ Н 238 H CR4 CH₃ 197 Н Η 19 4-C₆H₅-CH₂O H 20 4-(ClCH₂CH(CH₃)CH₂) H CH₃ H 160 CR4 CH3 168 H CR4 2,4-Cl₂ 21 H H 245 CR4 3-CF3 Н 184 30 22 CR4 H 243 23 CH=CH-CH=CH 248 CH=CH-CH=CH cr4 CH₃ CH3 H 200 CR4 26 166 H Н H 35

O.Z. 0050/35319

	- Nr	. R ¹	R ²	_R 3 ·	R^4	A	Fp. (°C	;) 7
	27	4-C(CH ₃) ₃	H	H	H	CR 4	210	
	28	3-CF ₃	CH ₃	Ĥ	CO2C	H_ CR ⁴	273	
	29	3-CF ₃	CH ₃	H	co ₂ c ₂ i	H_ CR4	196	
5	30	4-c(cH ₃) ₃	H	H	c ₆ H ₅	CR ⁴	231	
	31	4-CN	H	CH3	н	CR ⁴	229	
	32	4-C(CH ₃) ₃	H	CH3	Br	cr ⁴	258	į :
10	34	= B-Naphthyl	н	CH ³	Н	cr ⁴	242	•
		$\mathbb{R}^{1}_{\checkmark}$						
	35	$\langle \bigcirc \rangle = \varnothing - \text{Naphthyl}$	Н	CH ₃	H	cr ⁴	211	
	36	2-CH ₃	H	H 3	_	N	252	
	37	3-CH ₃	H	H	_	N	222	
15	38	3-CH ₃ O	H	H	-	N	246	
	39	3-CF3	H	H	-	N	280	
	41	4-c(čH ₃) ₃	H	. Н	-	. N	327	•
٠	42	3-C1	H	H	-	N	282	
	43	4-Br	H	H	_	N	303	
20	44	3-C ₆ H ₅ O	H	H	-	N	250	
	45	4-Cl	H	H	-	N .	257	
	46	4-C ₂ H ₅	H	H		N	268	
~	47	$4-C(CH_2)_2$; $2-CH_2$	H	H	_	N	288	
	48	4-C ₆ H ₅	H	H	-	N	300	
25	49	4-C ₆ H ₅ 4-H ₁₃ C ₆ -O 4-1-C ₃ H ₇ 3,4-Cl ₂	H	H	-	N	256	
	50	4-1-C3 ^H 7	H	H	-	N	272	
•	51	3,4-Cl ₂	H	Н	-	N	284	
	52	2,4 - 01 ₂	H	Н	-	N	283	
20	53	4(ClCH ₂ CH(CH ₃)CH ₂)	H	H	-	N	217	
30	54	4-C6H5CH2-0	H	H	-	N	268	

0. Z. 0050/35319

	Nr.	. R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	Fp. (°C)
	55	4-CN	H	H ·	-	N	345
	57	4-c(cH ₃)3	H	с ₆ н ₅	-	N	370
	58	4-c(cH ₃) ₃	CH ₃	CH ₃	H	CR ⁴	242
5	59	$. 4-C(CH_3)_3$	C2H5	CH3	H	cr4	168
	60	4-c(cH ₃) ₃	n-C ₃ H ₇		H	cr ⁴	192
	61	4(4'-C(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂	o) H	CH ³	H	CR ⁴	207
	62	4-c(CH ₃) ₃	Н	CH3	CN	CR ⁴	300
10	63	- = beta-Naphthyl	H	H ·	-	N	201
	64	4-cycl.C6H11	Н	CH ₃	Н	CR4	200
	65	4-c(CH ₃) ₃	CH ₃	CH ₃	Br	CR ⁴	260
	66	4-C ₂ H ₅ O	CH ₃	CH ₃	H	CR ⁴	218
15	67	4-C ₂ H ₅ O	н	H	-	N	258
•	68	4-C ₂ H ₅ O	H	CH ₃	Н	cr ⁴	185
	69	4-C ₂ H ₅ O	CH ₃	Н	-	N .	202
	70	4-nH ₁₃ C ₆ O	CH3	.сн ³	H	cr ⁴	168
	71	4(CH ₂ =CH-CH ₂ O)	H	н	-	N	235
20	72	4(CH ₂ =CH-CH ₂ O)	H	CH ₃	H	CR ⁴	161
	73	^{4 (n-С} 4 ^Н 9-СН-СН ₂ О) С ₂ Н ₅	H	CH ₃	H	CR ⁴	102
	74	4(n-C ₄ H ₉ -CH-CH ₂ O) C ₂ H ₅	H	Н	<u> </u>	N	199
25	75	4(n-C ₁₂ H ₂₅ O)	H	CH3	Н	cr ⁴	98
	76	$4(n-C_{12}H_{25}O)$	H	H	-	N	198
	77	4(n-C ₄ H ₉ O)	H	CH ₃	H	CR ⁴	181
	78	4(n-C ₄ H ₉ O)	H	H	-	N ,	235
	79	4(1-C4H ₉ O)	H	CH ₃	H	cr ⁴	211
30	80	4(1-C4H ₉ 0)	H	H	-	N	270

In entsprechender Weise können die folgenden Verbindungen hergestellt werden:

10

15

20

nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	Fp. (°C) 7
33	4-C(CH ₃) ₃	H	-(CH ₂) ₃ -			
40	3-CF ₃	CH3	Ħ _	. J 	N	
56	4-C(CH ₃)3 3-CF ₃ 4-C(CH ₃)3	сн ³	H	-		

Die neuen Wirkstoffe zeigen eine starke fungitoxische Wirksamkeit gegen phytopathogene Pilze, insbesondere aus der Klasse der Phycomyceten. Die neuen Verbindungen sind daher beispielsweise geeignet zur Bekämpfung von Phytophthora infestans an Tomaten und Kartoffeln, Phytophthora parasitica an Erdbeeren, Phytophthora cactorum an Äpfeln, Pseudoperonospora cubensis an Gurken, Pseudoperonospora humuli an Hopfen, Peronospora destructor an Zwiebeln, Peronospora sparsa an Rosen, Peronospora tabacina an Tabak, Plasmopara viticola an Reben, Plasmopara halstedii an Sonnenblumen, Sclerospora macrospora an Mais, Bremia lactucae an Salat, Mucor mucedo an Früchten, Rhizopus nigricans an Rüben, Erysiphe graminis an Getreide, Uncinula necator an Reben, Podophaera leucotricha an Äpfeln, Sphaerotheca fuliginea an Rosen, Erysiphe cichoriacearum an Gurken. Die fungiziden

Mittel enthalten 0,1 bis 95 % (Gewichtsprozent) Wirkstoff, vorzugsweise 0,5 bis 90 %. Die Aufwandmengen liegen je nach

Art des gewünschten Effektes zwischen 0,1 und 5 kg Wirk-25 stoff je ha.

Die neuen Wirkstoffe können auch zusammen mit anderen Wirkstoffen, z.B. Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren und Fungiziden oder auch mit Düngemitteln vermischt und ausgebracht werden. In vielen Fällen erhält man bei der Mischung mit Fungiziden auch eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums; bei einer Anzahl dieser Fungizidmischungen treten auch synergistische Effekte auf, d.h. die fungizide Wirksamkeit des Kombinationsproduktes ist

O. Z. 0050/35319

größer als die der addierten Wirksamkeiten der Einzelkomponenten. Eine besonders günstige Vergrößerung des Wirkungsspektrums wird mit folgenden Fungiziden erzielt:

5 Manganethylenbisdithiocarbamat

Mangan-Zinkethylenbisdithiocarbamat

Ammoniak-Komplex von Zink-(N, N-ethylen-bis-dithiocarbamat)

N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid

N-Trichlormethyl-phthalimid

- 10 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol
 - 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol
 - 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol
 - 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol
 - 2,3-Dichlor-6-methyl-1,4-oxathiin-5-carbonsäureanilid
- 5 2-Methyl-5,6-dihydro-4-H-pyran-3-carbonsäure-anilid
 - 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsaureanilid
 - 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid
 - 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid

N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäure-

20 -amid

5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxa-zolidin

3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxa-zolidin-2,4-dion.

25

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen kombiniert werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken.

30

Fungizide, die mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen kombiniert werden können sind beispielsweise:

Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat

O. Z. 0050/35319

```
Zinkdimethyldithiocarbamat
     Zinkethylenbisdithiocarbamat
     Tetramethylthiuramdisulfide
     Zink-(N,N-propylen-bis-dithiocarbamat)
 5
     Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocar-
     bamat) und
     N, N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)-disulfid
     Nitroderivate, wie
10
     Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat
     2-sec.-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat
     2-sec.-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat
    heterocyclische Strukturen, wie
15
    2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat
    2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin
    0,0-Diethyl-phthalimidophosphonothioat
    5-Amino-1-(bis-(dimethylamino)-phosphinyl)-3-phenyl-1,2,4-
    -triazol)
20
   2,3-Dicyano-1,4-dithiaanthrachinon
    2-Thio-1,3-dithio-(4,5-b)-chinoxalin
    1-(Butylcarbamoy1)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester
    4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazolon
    Pyridin-2-thio-1-oxid
25 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz
    2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-
   -dioxid
    2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin
    2-(Furyl-(2))-benzimidazol
30
    Piperazin-1,4-di-yl-bis-(1-(2,2,2-trichlor-ethyl)-form-
    amid
    2-(Thiazoly1-(4)-benzimidazol
    5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin
    Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol
    1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol
```

1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat

5 3-(3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl)-glutar-imid

Hexachlorbenzol

N-Dichlorfluormethylthio-N', N'-dimethyl-N-phenyl-schwefel-säurediamid

- 10 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid
 - 2-Methyl-benzoesäure-anilid
 - 2-Jod-benzoesäure-anilid
 - 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan
 - 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze
- 15 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze
 - 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-
 - -2-butanon
 - 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-
 - -2-butanol
- 20 α -(2-Chlorphenyl)- α -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol.

Die neuen Wirkstoffe werden beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentige wäßrige, ölige oder sonstige Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten, durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen, Beizen oder Gießen angewendet. Die Aufwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall mög-

30 lichst die feinste Verteilung der neuen Wirkstoffe gewährleisten.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten und Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin

oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle usw., sowie öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische
und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol,
Kylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate z.B. Methanol, Ethanol, Propanol,
Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol,
Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron usw., stark polare
Lösungsmittel, wie z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid,
N-Methylpyrrolidon, Wasser usw. in Betracht.

10

15

20

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulvern), öldispersionen durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen Lösungsmittel gelöst, mittels Haft-, Netz-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind. Als ober-flächenaktive Stoffe kommen in Betracht:

Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäuren, Phenolsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Alkali- und Erd-25 alkalisalze der Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Laurylethersulfat, Fettalkoholsulfate, fettsaure Alkali- und Erdalkalisalze, Salze sulfatierter Hexadecanole, Heptadecanole, Octadecanole, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem 30 Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Poloxyethylenoctylphenylether, ethoxyliertes Isooctylphenol-, Octyl-35 phenol-, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylakoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Lignin, Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Pulver, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

10

15

35

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulaten, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste
Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind
z.B. Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kreide,
Talkum, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calciumund Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe,
Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat,
Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie

20 Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Für die folgenden Versuche wurden als bekannte Vergleichswirkstoffe die folgenden Verbindungen verwendet.

Getreidemehle, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehle.

N-Trichlormethylthio-phthalimid (Verbindung A),
7-Amino-2-methyl-5-phenyl-pyrazolo[1,5-a]-pyrimidin
(Verbindung B).

Versuch 1

30 Wirksamkeit gegen Plasmopara viticola

Blätter von Topfreben der Sorte "Müller-Thurgau" wurden mit wäßriger Spritzbrühe, die 80 % (Gew.%) Wirkstoff und 20 % Emulgiermittel in der Trockensubstanz enthielt, besprüht. Um die Wirkungsdauer der Wirkstoffe beurteilen zu

können, wurden die Pflanzen nach dem Antrocknen des Spritzbelages 10 Tage im Gewächshaus aufgestellt. Erst dann wurden die Blätter mit einer Zoosporenaufschwemmung von Plasmopara viticola (Rebenperonospora) infiziert. Danach wurden die Reben zunächst für 16 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24°C und anschließend für 8 Tage in einem Gewächshaus mit Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in der feuchten Kammer aufgestellt. Dann erfolgte die Beurteilung des Ausmaßes des Pilzausbruches auf den Blattunterseiten. Beispielsweise zeigten die Wirkstoffe 1, 5, 10, 11, 12, 13, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 27, 37, 41, 42, 44 bei Anwendung einer 0,025 %igen Wirkstoffbrühe eine bessere fungizide Wirkung (beispielsweise 100 %ige Wirkung) als die bekannten Vergleichsmittel A und B (beispielsweise 60 %ige Wirkung).

- 18 -

Beispiele für Zubereitungen sind:

20

15

10

I. Man vermischt 90 Gew.-Teile der Verbindung 1 mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl-alpha-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist.

25

II. 20 Gew.-Teile der Verbindung 5 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gew.-Teilen Xylol, 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-mono-ethanolamin, 5 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion.

0050/35319

0. Z.

- III. 20 Gew.-Teile der Verbindung 10 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion.
- IV. 20 Gew.-Teile der Verbindung 11 werden in einer

 Mischung gelöst, die aus 25 Gew.-Teilen Cyclohexanol,
 65 Gew.-Teilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt
 210 bis 280°C und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl
 besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der
 Lösung in Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion.
- V. 80 Gew.-Teile der Verbindung 37 werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-alpha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Lignin-sulfonsäure aus einer Sulfitablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in der Mischung in Wasser erhält man eine Spritzbrühe.
- VI. 3 Gew.-Teile der Verbindung 41 werden mit 97 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- VII. 30 Gew.-Teile der Verbindung 42 werden mit einer
 Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die
 Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde,
 innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine
 Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.

0. Z. 0050/35319

- VIII. 40 Gew.-Teile der Verbindung 44 werden mit 10 Teilen Natriumsalz eines Phenolsulfonsäure-harnstoff-form-aldehyd-Kondensates, 2 Teilen Kieselgel und 48 Teilen Wasser innig vermischt. Man erhält eine stabile wäßrige Dispersion. Durch Verdünnen mit Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion.
- IX. 20 Teile der Verbindung 1 werden mit 2 Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Teilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Teilen Natriumsalz eines
 Phenolsulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensats
 und 68 Teilen eines paraffinischen Mineralöls innig
 vermischt. Man erhält eine stabile ölig Dispersion.

15

5

20

25

- Patentansprüche

1. 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine der Formel

$$R^{1} \xrightarrow{R^{2}} N^{H_{2}} \xrightarrow{N^{H_{2}}} I$$

10 worin

15

20

25

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet, wobei

die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

2. Fungizid enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

, NH₂

$$R^{1} \xrightarrow{N^{1}} R^{2}$$

$$R^{2} \xrightarrow{N^{1}} A$$

35

15

25

- 22 -

worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind.

10 n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet, wobei

die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

Fungizid, enthaltend einen festen oder flüssigen
 Trägerstoff und ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} & & & \\
 & & & \\
R^{2} & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\$$

worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil

10

15

20

25

durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

 \mathbb{R}^2 und \mathbb{R}^3 Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet, wobei

die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

4. Verfahren zur Herstellung eines Fungizids, <u>dadurch</u>
<u>gekennzeichnet</u>, daß man einen festen oder flüssigen
Trägerstoff vermischt mit einem 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidin der Formel

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & & & \\
R^2 & & & \\
R^2 & & & \\
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
N^{H_2} & & \\
R^3 & & \\
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
I & & \\
\end{array}$$

worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR⁴-Gruppe bedeutet, wobei

35

. 5

10

15

20

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

Verfahren zur Bekämpfung von Pilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall
zu schützenden Gegenstände behandelt mit einem
7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

 $\begin{array}{c|c}
R^1 & & & \\
& & & \\
R^2 & & & \\
& & & \\
\end{array}$ $\begin{array}{c}
NH_2 \\
N & & \\
\end{array}$ $\begin{array}{c}
NH_2 \\
N & & \\
\end{array}$ $\begin{array}{c}
NH_2 \\
N & & \\
\end{array}$

worin

R1 gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring
annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil
durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

25 n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet, wobei

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

6. Verfahren zur Herstellung eines 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidins der Formel

$$R^{1} \xrightarrow{\mathbb{N}^{1}} \mathbb{N}^{1} \times \mathbb{R}^{3}$$

worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

 \mathbb{R}^2 und \mathbb{R}^3 Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet, wobei

die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

<u>dadurch gekennzeichnet</u>, daß man ein substituiertes Benzylcyanid der Formel

$$\begin{array}{c|c}
 & CH-CN \\
 & C=0 \\
 & R^2
\end{array}$$

in der R¹ und R² die im Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, mit einem 5(3)-Aminopyrazol der Formel

35

30

10

15

20

25

J

Q.Z. 0050/35319

5

oder mit einem 5(3)-Amino-1,2,4-triazol der Formel

10

in welcher \mathbb{R}^3 und \mathbb{R}^4 die im Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt.

15

7. 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R² Wasserstoff oder Methyl, R³ Wasserstoff oder Methyl und R⁴ Wasserstoff bedeutet.

20

8. Fungizid, enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyri-midin, definiert wie in Anspruch 1, <u>dadurch gekenn-zeichnet</u>, daß R² Wasserstoff oder Methyl, R³ Wasserstoff oder Methyl und R⁴ Wasserstoff bedeutet.

25

- 27 -

Patentansprüche (für Österreich)

Fungizid enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimi-1. din der Formel

5

$$R^{1} \xrightarrow{N^{H_{2}}} R^{3}$$

10

worin

15

 R^1 gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

20

1 oder 2 n

und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

Α

ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet,

wobei

25

 R^4 die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R3 eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

30

2. Fungizid, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

10

15

20

O.Z. 0050/35319

$$R^{1} \xrightarrow{NH_{2}} N^{N} \xrightarrow{N} R^{3}$$

worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet, wobei

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

Verfahren zur Herstellung eines Fungizids, <u>dadurch</u>
<u>gekennzeichnet</u>, daß man einen festen oder flüssigen
Trägerstoff vermischt mit einem 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidin der Formel

$$R^{1} \xrightarrow{NH_{2}} N^{N} \xrightarrow{N} R^{3}$$

10

15

O.Z.0050/35319

worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet, wobei

die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

Verfahren zur Bekämpfung von Pilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall
zu schützenden Gegenstände behandelt mit einem
7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

worin

gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphtha-

35

30

10

15

20

25

30

35

O.Z. 0050/35319

lin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

 R^2 und R^3 Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet, wobei

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R³ eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

5. Verfahren zur Herstellung eines 7-Amino-azolo[1,5-a]-

$$R^{1}$$
 $N^{H_{2}}$ N^{N} $N^{R_{3}}$ $N^{R_{3}}$

worin

R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

a² und R³ Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR4-Gruppe bedeutet, wobei

R⁴ die Bedeutung von R² hat und zusätzlich Halogen,

- 31 -

O.Z. 0050/35139

Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R3 7 eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet,

dadurch gekennzeichnet, daß man ein substituiertes Benzylcyanid der Formel

10

15

5

in der R¹ und R² die im Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, mit einem 5(3)-Aminopyrazol der Formel

H₂N N N III,

oder mit einem 5(3)-Amino-1,2,4-triazol der Formel

20

25

in welcher R³ und R⁴ die im Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt.

6. Fungizid, enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyri-30 midin, definiert wie in Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R² Wasserstoff oder Methyl, R³ Wasserstoff oder Methyl und R4 Wasserstoff bedeutet.